

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 1 月 6 日 (06.01.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/000825 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 277/46, 277/40,  
417/12, 417/04, A61K 31/426, 31/454, A61P 9/10, 9/12,  
11/02, 11/06, 13/12, 25/02, 25/18, 25/22, 25/24, 25/28,  
27/02, 27/06, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/009249

(22) 国際出願日: 2004 年 6 月 23 日 (23.06.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-184321 2003 年 6 月 27 日 (27.06.2003) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友製薬  
株式会社 (SUMITOMO PHARMACEUTICALS CO.,  
LTD.) [JP/JP]; 〒5418510 大阪府大阪市中央区道修町  
2 丁目 2-8 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山口 洋輝 (YAM-  
AGUCHI, Hiroki) [JP/JP]; 〒5540022 大阪府大阪市此  
花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会社内 Osaka  
(JP).

(74) 代理人: 五十部 穰 (ISOBE, Yutaka); 〒5540022 大阪  
府大阪市此花区春日出中3丁目1-98 住友製薬株式会  
社 知的財産部内 Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

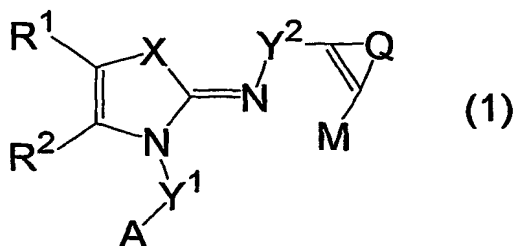
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可  
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,  
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,  
IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,  
BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,  
TD, TG).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: THIAZOLIMINE COMPOUND AND OXAZOLIMINE COMPOUND

(54) 発明の名称: チアゾールイミン類およびオキサゾールイミン類



(57) Abstract: A compound represented by the formula (1):  
(wherein X represents sulfur or oxygen; R<sup>1</sup> and R<sup>2</sup> each represents  
a group represented by the formula -Y<sup>3</sup>-Z, etc.; Y<sup>3</sup> represents a  
single bond or (un)substituted alkylene; Y<sup>1</sup> and Y<sup>2</sup> each represents  
(un)substituted alkylene; Z represents hydrogen, an (un)saturated  
monocyclic heterocyclic group, etc.; M represents carboxy, etc.;  
Q represents o-phenylene, etc.; and A represents an (un)saturated  
monocyclic hydrocarbon group, etc.), a prodrug thereof, or a  
pharmaceutically acceptable salt of either. They are compounds  
having chymase inhibitory activity and useful as a therapeutic agent  
for hypertension, cardiac failure, etc.

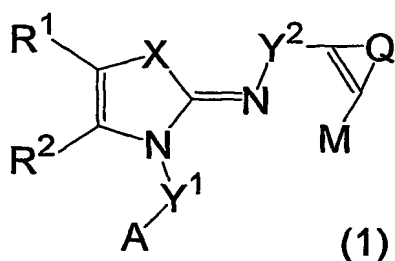
[続葉有]

WO 2005/000825 A1



(57) 要約:

式 (1) :



[式中、Xは硫黄原子または酸素原子を表し、 $R^1$  および  $R^2$  は式:  $-Y^3-Z$  で表される基等を、 $Y^3$  は単結合、または置換もしくは無置換のアルキレン基を、 $Y^1$  および  $Y^2$  は置換もしくは無置換のアルキレン基を、Zは水素原子、または飽和もしくは不飽和の単環式複素環基等を、Mはカルボキシル基等を、Qは、 $\alpha$ -フェニレン等を、Aは飽和もしくは不飽和の単環式炭化水素環基等を表す] で表される化合物もしくはそのプロドラッグまたはそれらの医薬として許容される塩で、キマーゼ阻害活性を有し、高血圧症、心不全等の治療薬として有用な化合物を提供する。